

**This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

**Defective images within this document are accurate representations of  
the original documents submitted by the applicant.**

**Defects in the images may include (but are not limited to):**

- **BLACK BORDERS**
- **TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- **FADED TEXT**
- **ILLEGIBLE TEXT**
- **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- **COLORED PHOTOS**
- **BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS**
- **GRAY SCALE DOCUMENTS**

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

**PRIORITY  
DOCUMENT**  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



REC'D 27 SEP 2000

WIPO PCT

EP 00/07523

4

**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung**

**Aktenzeichen:** 199 38 737.0

**Anmeldetag:** 16. August 1999

**Anmelder/Inhaber:** Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen/DE

**Bezeichnung:** Aminosalicylsäureamide

**IPC:** C 07 C, C 07 D, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Anmeldung.**

München, den 6. Juli 2000  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
Der Präsident  
Im Auftrag

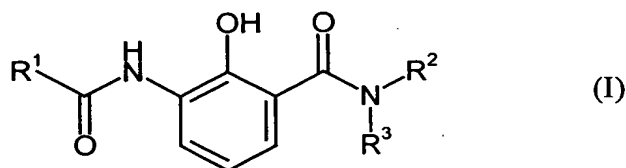
Agurks

Aminosalicylsäureamide

Die Erfindung betrifft bekannte und neue Acylaminosalicylsäureamide, mehrere  
5 Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzen-  
schädigenden Organismen, sowie neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren  
Herstellung.

Bestimmte Aminosalicylsäureamide, sowie deren fungizide Wirkung sind bereits  
bekannt geworden (vergleiche z. B. WO 97-08135 oder WO 98-41513). Die Wirkung  
dieser vorbekannten Verbindungen ist jedoch insbesondere bei niedrigen Aufwand-  
mengen und Konzentrationen nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufrieden-  
stellend.

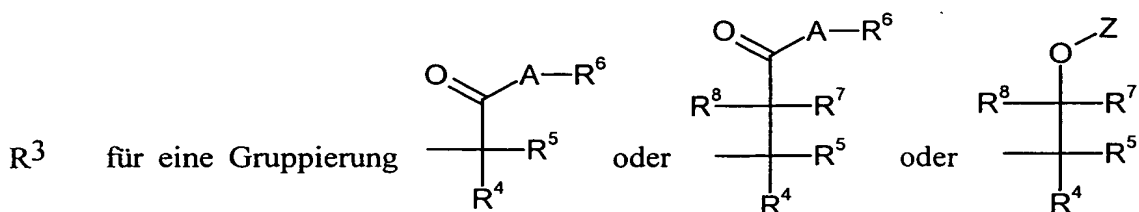
15 Es wurde nun gefunden, daß die Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen  
Formel (I),



in welcher

20 R¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,

R² für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder



steht, worin

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $-(N-R^9)-$  steht, worin

5

$R^9$  für Wasserstoff oder Alkyl steht oder gemeinsam mit  $R^6$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bildet,

10

$R^4$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl steht oder

$R^2$  und  $R^4$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

15

$R^5$  für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

$R^4$  und  $R^5$  gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden,

20

$R^6$  für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

$R^7$  für Wasserstoff oder Alkyl steht,

25

$R^8$  für Wasserstoff oder Alkyl steht und

Z für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Aryl, Arylcarbonyl, Heterocyclyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,

5 sich zur Bekämpfung von Organismen, die Pflanzenschäden und Schäden an technischen Materialien verursachen, eignen.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkylen, Alkenyl oder Alkinyl, auch in Verknüpfung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino, jeweils geradkettig oder verzweigt. Bevorzugt sind, wenn nicht anders angegeben, Kohlenwasserstoffketten mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

15

Aryl steht für aromatische, mono oder polycyclische Kohlenwasserstoffringe, wie z.B. Phenyl, Naphthyl, Anthranyl, Phenanthryl, vorzugsweise für Phenyl oder Naphthyl, insbesondere für Phenyl.

20

Heterocyclyl steht für gesättigte oder ungesättigte, sowie aromatische, ringförmige Verbindungen mit bis zu acht Ringgliedern, in denen mindestens ein Ringglied ein Heteroatom, d. h. ein von Kohlenstoff verschiedenes Atom, ist. Enthält der Ring mehrere Heteroatome, können diese gleich oder verschieden sein. Heteroatome sind bevorzugt Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel. Enthält der Ring mehrere Sauerstoffatome, stehen diese nicht direkt benachbart. Gegebenenfalls bilden die ringförmigen Verbindungen mit weiteren carbocyclischen oder heterocyclischen, ancondensierten oder überbrückten Ringen gemeinsam ein polycyclisches Ringsystem. Bevorzugt sind mono- oder bicyclische Ringsysteme, insbesondere mono- oder bicyclische, aromatische Ringsysteme.

25

30

Cycloalkyl steht für gesättigte, carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen ein polycyclisches Ringsystem bilden.

- 5 Cycloalkenyl steht für carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die mindestens eine Doppelbindung enthalten und gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen ein polycyclisches Ringsystem bilden.

Halogenalkoxy steht für teilweise oder vollständig halogeniertes Alkyl. Bei mehrfach halogeniertem Halogenalkoxy können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Bevorzugte Halogenatome sind Fluor oder Chlor, insbesondere Fluor. Trägt das Halogenalkoxy noch weitere Substituenten, reduziert sich die maximal mögliche Zahl der Halogenatome auf die verschiedenen freien Valenzen.

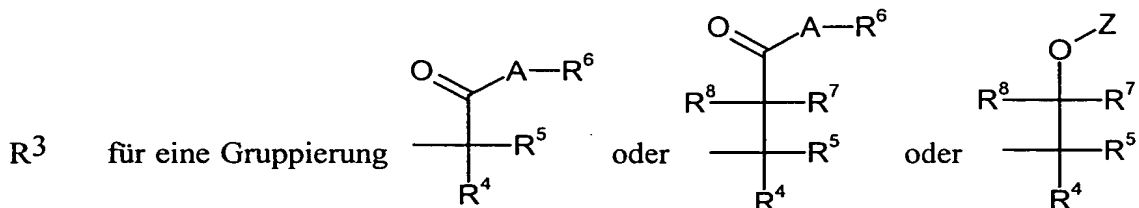
- 15 Halogenalkyl steht für teilweise oder vollständig halogeniertes Alkyl. Bei mehrfach halogeniertem Halogenalkyl können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Bevorzugte Halogenatome sind Fluor, oder Chlor, insbesondere Fluor. Trägt das Halogenalkyl noch andere Substituenten, reduziert sich die maximal mögliche Zahl der Halogenatome auf die verschiedenen freien Valenzen.

- 20 Die Verbindungen der Formel (I) liegen gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren vor. Es werden sowohl die Verwendung der E- als auch die Z-Isomeren, wie auch der threo- und erythro-, sowie  
25 der optischen Isomeren sowie beliebiger Mischungen dieser Isomeren beansprucht.

Bevorzugt ist die Verwendung von Verbindungen der Formel (I), in welcher

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und



steht, worin

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $-(N-R^9)-$  steht, worin

R<sup>9</sup> für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht oder gemeinsam mit R<sup>6</sup> und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten heterocyclischen Ring mit 3 bis 7 Ringgliedern bildet,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht oder

R<sup>2</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

5      R<sup>6</sup>    für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

      R<sup>7</sup>    für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

      R<sup>8</sup>    für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und

15      Z    für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl oder Alkylcarbonyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Cycloalkylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylcarbonyl, Arylalkyl, Arylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylalkyl oder Heterocyclylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht.

20      Bevorzugte Substituenten für Aryl oder Arylalkyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

      Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

25      jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

      jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;



jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5       jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroxyiminoalkyl oder Alkoxyiminoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

15       jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen; sowie

20       Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Aryl und Aryloxy.

Bevorzugte Substituenten für Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

25

Halogen, Amino, Hydroxy, Oxo,

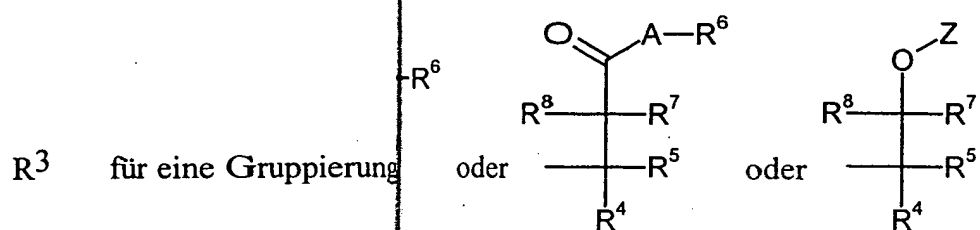
Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen.

30

Besonders bevorzugt ist die Bildung von Verbindungen der Formel (I), in welcher

$R^1$  für Wasserstoff oder

$R^2$  für Wasserstoff, Methyl- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und



steht, worin

A für Sauerstoff, oder  $-(N-R^9)-$  steht, worin

$R^9$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, gegebenenfalls zusammen mit  $R^6$  und dem Stickstoffatom, an das sie steht, für gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituiertes Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Piperidinyl, Piperazinyl, hydroazepinyl steht,

$R^4$  für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls unsubstituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy, gegebenenfalls substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder im Methylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl steht oder

R<sup>2</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

5 R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropanring, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen,

15 R<sup>6</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl oder Cyclohexyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl oder durch Pyrrolidonyl substituiertes Methyl, Ethyl oder Propyl steht,

20 R<sup>7</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

25 R<sup>8</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

30 Z für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n- oder i-Propylcarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylcarbonyl, Pentylcarbonyl, Hexylcarbonyl, Heptylcarbonyl, Octylcarbonyl, gegebenenfalls durch Methyl,

5

Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentylcarbonyl oder Cyclohexylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyll, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl, Phenylcarbonyl, Benzylcarbonyl, 1-Phenethylcarbonyl, 2-Phenethylcarbonyl, Phenylcarbonylpropylcarbonyl, Phenylcarbonylbutylcarbonyl, Phenylcarbonylpentylcarbonyl oder Phenylcarbonylhexylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonyl, Morpholinylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonylbutylcarbonyl oder Morpholinylcarbonylbutylcarbonyl steht.

Besonders bevorzugte Substituenten für Phenyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

15

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-  
 carbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy,  
 n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethyl-  
 sulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluor-  
 methoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio,  
 Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluor-  
 methylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methyl-  
 amino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl,  
 Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy,  
 Ethylsulfonyloxy, Hydroxyiminomethyl, Hydroxyiminoethyl, Methoxyiminomethyl,  
 Ethoxyiminomethyl, Methoxyiminoethyl oder Ethoxyiminoethyl,

25

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zwei-

fach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl oder Phenoxy.

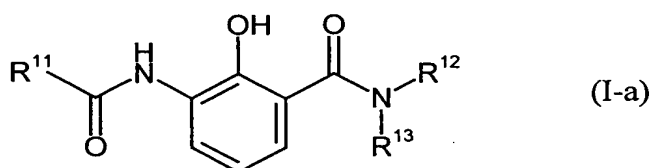
5

Besonders bevorzugte Substituenten für Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

Halogen, Amino, Hydroxy, Oxo, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.

Die vorliegende Anmeldung betrifft ferner neue substituierte Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I-a),

15

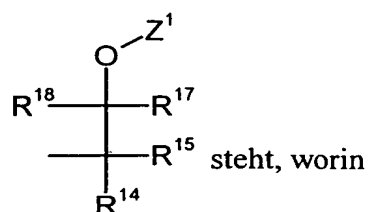
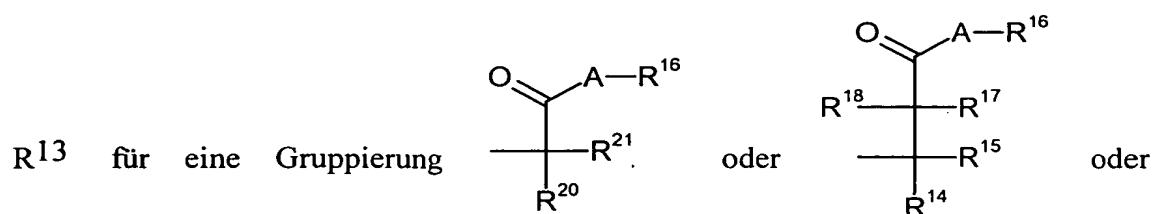


in welcher

20

R¹¹ für Wasserstoff oder Alkyl steht,

R¹² für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder



A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N} \text{---} \text{R}^{19})\text{---}$  steht, worin

R<sup>19</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder gemeinsam mit R<sup>16</sup> und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bildet,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

R<sup>15</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht und

R<sup>18</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

5 Z<sup>1</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkyl-carbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Aryl, Arylcarbonyl, Heterocyclyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,

R<sup>20</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Hetaryl steht oder

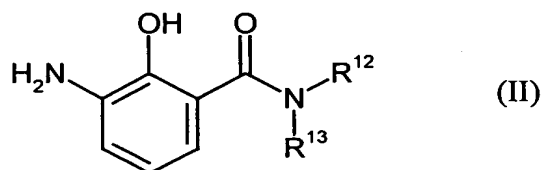
R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

15 R<sup>21</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden.

20 Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen substituierten Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I-a) erhält, wenn man

a) Aminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (II),



25 in welcher

$R^{12}$  und  $R^{13}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einem Acylierungsmittel der allgemeinen Formel (III),



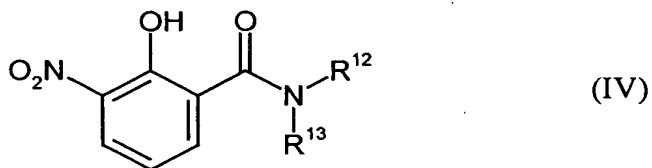
in welcher

$R^{11}$  die oben angegebene Bedeutung hat und

$X^1$  für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umgesetzt, oder wenn man

b) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

$R^{12}$  und  $R^{13}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umgesetzt.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen liegen gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren vor. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren sowie beliebige Mischungen dieser Isomeren beansprucht.

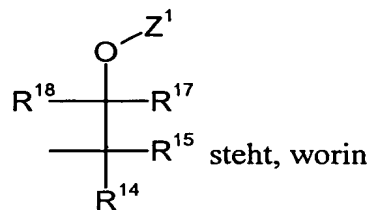
5

Bevorzugt sind die neuen Verbindungen der Formel (I-a), in welcher

$R^{11}$  für Wasserstoff oder Methyl steht,

$R^{12}$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht und

$R^{13}$  für eine Gruppierung

$$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{A} \text{---} \text{R}^{16} \\ | \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{R}^{21} \\ | \\ \text{---} \text{R}^{20} \end{array} \quad \text{oder} \quad \begin{array}{c} \text{O} \text{---} \text{A} \text{---} \text{R}^{16} \\ | \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{R}^{17} \\ | \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{R}^{15} \\ | \\ \text{---} \text{R}^{14} \end{array} \quad \text{oder}$$


A für Sauerstoff, Schwefel oder  $-(N-R^{19})-$  steht, worin

$R^{19}$  für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht oder gemeinsam mit  $R^{16}$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituierten heterocyclischen Ring mit 3 bis 7 Ringgliedern bildet,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>15</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder durch Pyrrolidonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und

R<sup>18</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

Z<sup>1</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl oder Alkylcarbonyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Cycloalkylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substi-

tuiertes Aryl, Arylcarbonyl, Arylalkyl, Arylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylalkyl oder Heterocyclylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

5

R<sup>20</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

15

R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>21</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

20

R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden.

Bevorzugte Substituenten für Aryl oder Arylalkyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

25

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

30

Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen.

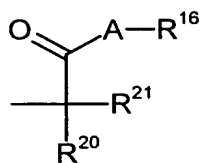
Die Erfindung betrifft insbesondere die neuen Verbindungen der Formel (I), in

5

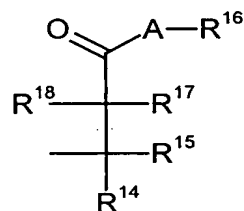
$R^{11}$  für Wasserstoff oder Methyl steht,

$R^{12}$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

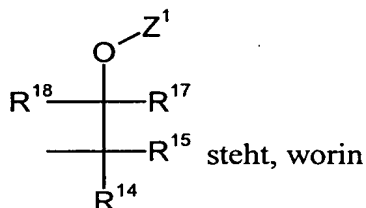
$R^{13}$  für eine Gruppierung



oder



oder



A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N} \text{---} \text{R}^{19})\text{---}$  steht, worin

$R^{19}$  für Wasserstoff oder Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder gemeinsam mit  $R^{16}$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituiertes Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Piperidinyl, Piperazinyl oder Hexahydroazepinyl steht,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

R<sup>15</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropan-, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl oder Cyclohexyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl oder durch Pyrrolidonyl substituiertes Methyl, Ethyl oder Propyl steht,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

5

Z<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n- oder i-Propylcarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylcarbonyl, Pentylcarbonyl, Hexylcarbonyl, Heptylcarbonyl, Octylcarbonyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentylcarbonyl oder Cyclohexylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl, Phenylcarbonyl, Benzylcarbonyl, 1-Phenethylcarbonyl, 2-Phenethylcarbonyl, Phenylcarbonylpropylcarbonyl, Phenylcarbonylbutylcarbonyl, Phenylcarbonylpentylcarbonyl oder Phenylcarbonylhexylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonyl, Morpholinylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonylbutylcarbonyl oder Morpholinylcarbonylbutylcarbonyl steht,

15

20

R<sup>20</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl oder substituiertes Benzyl steht oder

25

R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

R<sup>21</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropanring, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

Besonders bevorzugte Substituenten für Phenyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-  
carbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy,  
n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethyl-  
sulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluor-  
methoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio,  
Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluor-  
methylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methyl-  
amino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl,  
Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy,  
Ethylsulfonyloxy, Hydroxyiminomethyl, Hydroxyiminoethyl, Methoxyiminomethyl,  
Ethoxyiminomethyl, Methoxyiminoethyl oder Ethoxyiminoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,  
Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zwei-  
fach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl),  
Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl oder Phenoxy.

Besonders bevorzugte Substituenten für Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl sind in der nachstehenden Aufzählung aufgeführt:

5

Halogen, Amino, Hydroxy, Oxo, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

15

Die in den jeweiligen Kombinationen bzw. bevorzugten Kombinationen von Resten im einzelnen für die angegebenen Restdefinitionen werden unabhängig voneinander von den jeweilig angegebenen Kombinationen der Reste, beliebig auch durch Restdefinitionen anderer ersetzt.

20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Aminosalicylsäureamide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben  $R^{12}$  und  $R^{13}$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^{12}$  und  $R^{13}$  angegeben wurden.

25

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind teilweise bekannt (vergleiche z.B. J. Heterocycl. Chem. (1971), 8(6), 989-91).



oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

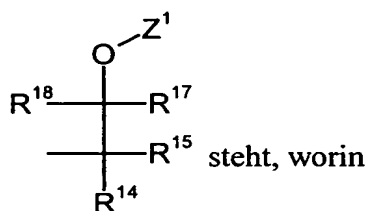
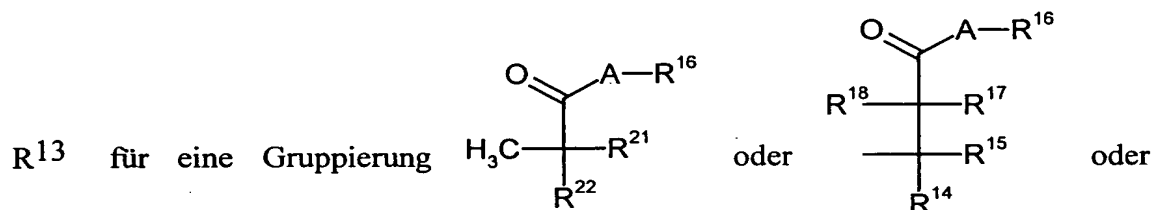
5

$R^{22}$  und  $R^{12}$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

$R^{22}$  und  $R^{21}$  gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden.

Bevorzugt sind Aminosalicylsäureamide der Formel (II-a), in welcher

$R^{12}$  die oben angegebene Bedeutung hat, und



A,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $Z^1$  und  $R^{21}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

$R^{22}$  für durch Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Aryl-carbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkyl-carbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder unsubstituiertes  $C_2$ - $C_4$ -Alkyl, jeweils ge-

benenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

5

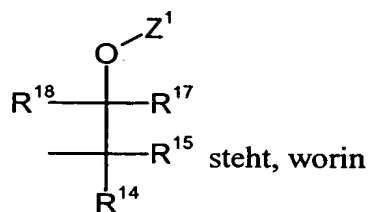
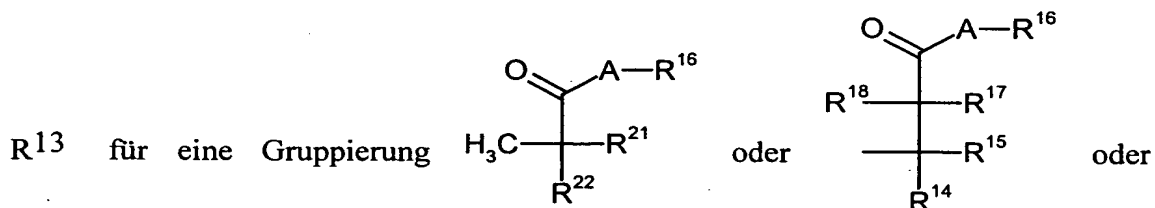
$R^{22}$  und  $R^{12}$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen oder

$R^{22}$  und  $R^{21}$  gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

Besonders bevorzugt sind Aminosalicylsäureamide der Formel (II-a), in welcher

$R^{12}$  die oben angegebene Bedeutung hat, und

15



A,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $Z^1$  und  $R^{21}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

$R^{22}$  für jeweils durch Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio,

5

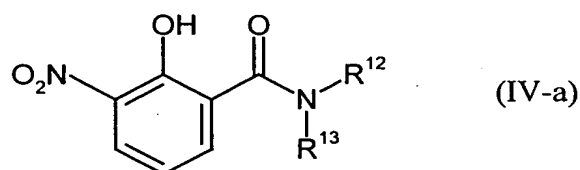
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder unsubstituiertes Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl oder substituiertes Benzyl steht oder

R<sup>22</sup> und R<sup>12</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen oder

R<sup>22</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

15

Die Aminosalicylsäureamide der Formel (II-a) werden erhalten, wenn man (Verfahren c) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV-a),



in welcher

20

R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

mit Wasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, vorzugsweise eines Esters wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Alkohols, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether; Wasser, einer Salzlösung, wie beispielsweise

Ammoniumchloridlösung, einer Säure, wie beispielsweise Salzsäure oder Essigsäure, sowie beliebigen Mischungen der genannten Verdünnungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle, umgesetzt.

5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrosalicylsäureamide sind durch die Formel (IV-a) allgemein definiert. In dieser Formel (IV-a) haben  $R^{12}$  und  $R^{13}$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (II-a) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^{12}$  und  $R^{13}$  angegeben wurden.

Die Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a) sind neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

15

Sie werden erhalten, wenn man (Verfahren d) 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäure oder 2-Hydroxy-3-nitrobenzoylchlorid mit einem Amin der Formel (V),

20  
in welcher

$R^{12}$  und  $R^{13}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, beispielhaft und vorzugsweise eines aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; eines halogenierten Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan,

25

Dichlorethan oder Trichlorethan; eines Ethers, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; eines Ketons, wie beispielsweise Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; eines Nitrils, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; eines Amids, wie beispielsweise N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; eines Esters wie beispielsweise Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Sulfoxids, wie beispielsweise Dimethylsulfoxid; oder eines Sulfons, wie beispielsweise Sulfolan, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, beispielsweise eines Säurehalogenidbildners wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; eines Anhydridbildners wie beispielsweise Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; eines Carbodiimides, wie beispielsweise N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder eines anderen üblichen Kondensationsmittels, wie beispielsweise Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ) oder Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, beispielhaft und vorzugsweise eines Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydrides, -hydroxides, -amids, -alkoholates, -acetates, -carbonates oder -hydrogencarbonates, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, oder eines tertiären Amines, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU), umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) als Ausgangsstoffe benötigte 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäure oder 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäurechlorid sind bekannt (vergleiche z. B. J. Het. Chem., 1971, 8(6), 889-891, J.Chem.Soc., 1953 2049, 2050 oder US-Patent 03527865).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens d) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben  $R^{12}$  und  $R^{13}$  beispielhaft und vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^{12}$  und  $R^{13}$  angegeben wurden.

Die Amine der Formel (VII) sind bekannte Reagentien in der organischen Chemie.

Die Verbindungen der Formel (I) sind teilweise bekannt und können nach teilweise bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Biochim. Biophys. Acta 1993, 262-268).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Acylierungsmittel sind durch die Formel (III), allgemein definiert. In dieser Formel (III) hat  $R^{11}$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^{11}$  angegeben wurde.  $X^1$  steht für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy, vorzugsweise für Chlor, Hydroxy, Methoxy, Ethoxy oder Acetoxy.

Die Acylierungsmittel der allgemeinen Formel (III) sind bekannte Reagenzien in der organischen Chemie.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrosalicylsäureamide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) haben  $R^{12}$  und  $R^{13}$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^{12}$  und  $R^{13}$  angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind teilweise bekannt (vergleiche z. B. J. Heterocycl. Chem. (1971), 8(6), 989-991).

Neu sind die Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a) die bereits weiter oben im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) beschrieben worden sind.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören beispielhaft und vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie beispielsweise Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie beispielsweise N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie beispielsweise Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie beispielsweise Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.

5

Das erfindungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Natriumhydrogencarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

15

Das erfindungsgemäße Verfahren b) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die auch für Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

20

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren a) und b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 130°C.

25

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Aminosalicylsäureamids der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 2000 Mol, vorzugsweise 1 bis 800 Mol Acylierungsmittel der Formel (III) ein.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Nitrosalicylsäureamides der Formel



(IV-a) im allgemeinen 100 bis 2000 Mol, vorzugsweise 200 bis 1000 Mol Ameisensäure ein.

5

Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

15

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

20

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

25

Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;

Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder

*Pseudoperonospora cubensis*;

30

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;  
 Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;  
 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;  
 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;  
 5 Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;  
 Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;  
 Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*  
 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
 Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*  
 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;  
 Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;  
 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;  
 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;  
 15 Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;  
 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;  
 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;  
 Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;  
 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;  
 20 Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;  
 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;  
 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;  
 Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;  
 Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

25

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Phytophthora- und Plasmopara-Arten, oder von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia-Arten, einsetzen.

5

Mit gutem Erfolg werden auch Getreidekrankheiten bekämpft.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

15

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint,

25

30

welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

#### **Fungizide:**

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fempiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

5 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb,

15 Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen (PCNB),

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,

20 Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,

Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,

Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

25 Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

$\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

30  $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

- $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy- $\alpha$ -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,  
 5 (E)- $\alpha$ -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,  
 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester  
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,  
 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,  
 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,  
 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,  
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,  
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,  
 15 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,  
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,  
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
 20 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,  
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- $\beta$ -D-glycopyranosyl)- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
 25 2-Aminobutan,  
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,  
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantomethyl)-acetamid,  
 2-Phenylphenol(OPP),  
 30 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,

- 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
 5 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,  
 8-Hydroxychinolinsulfat,  
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
 hydrochlorid,  
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
 Kaliumhydrogencarbonat,  
 15 Methantetrathiol-Natriumsalz,  
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.  
 20 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 25 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanocarboxamid,  
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
 30 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,



O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,  
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

5

**Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,  
 Othilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,  
 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

15

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,  
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,  
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,  
 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,  
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,  
 Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin,  
 Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos,  
 Butocarboxim, Butylpyridaben,

20

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap,  
 Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron,  
 Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin,  
 Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene,  
 Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

25

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,  
 Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton,  
 Docusat-sodium, Dofenapyn,

30

Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopftora spp.,  
 Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,  
 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,  
 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,

Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocyclothrinate, Flucyclohexuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

5 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isafenophos, Isoxathion, Ivermectin, Kernpolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M

15 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos,

20 Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos, Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocyclothrinate, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

25 Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

30 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

- (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat  
 (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat  
 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-  
 5 imin  
 2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol  
 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion  
 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid  
 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid  
 3-Methylphenyl-propylcarbamat  
 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol  
 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-  
 3(2H)-pyridazinon  
 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-  
 15 pyridazinon  
 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon  
 Bacillus thuringiensis strain EG-2348  
 Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid  
 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
 20 ester  
 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid  
 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd  
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat  
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin  
 25 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-  
 1-carboxamid  
 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin  
 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid  
 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid  
 30 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

5        Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sproßpilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) wie *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*-Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

15       Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das

20       Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

25       Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und

30       10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Auf-

wandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

**Herstellungsbeispiele****Beispiel 1:**

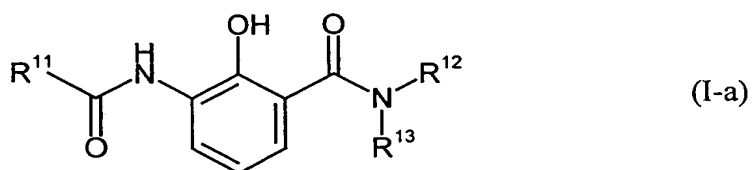
5      2-{[3-(Formylamino)-2-hydroxybenzoylamino]-3-(4-hydroxyphenyl)propan-  
säureethylester

**Verfahren b)**

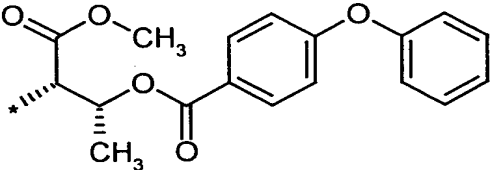
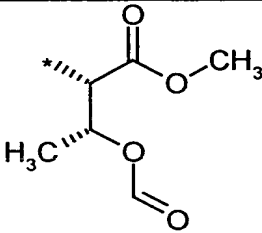
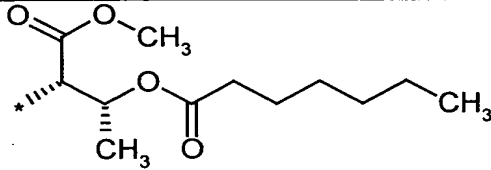
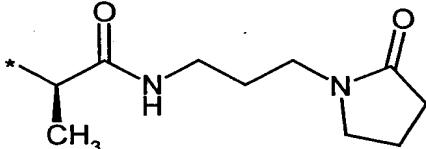
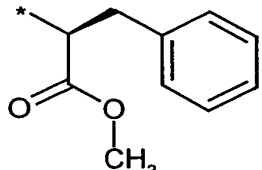
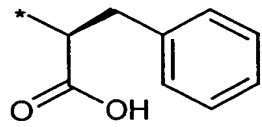
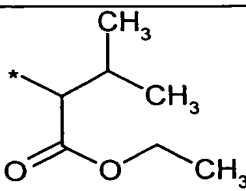
15      2.0 g (5.1 mmol) 2-[(2-Hydroxy-3-nitrobenzoyl)amino]-3-(4-hydroxyphenyl)propan-  
säureethylester wurden in 60 mL Ameisensäure suspendiert und mit 2.0 g Raney  
Nickel versetzt. Das Gemisch wurde 1 Stunde bei 90°C gerührt und anschließend  
filtriert. Das Filtrat wurde eingedampft, der Rückstand in Dichlormethan aufge-  
nommen und mit dest. Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über  
Natriumsulfat getrocknet und anschließend zur Trockne eingengt. Die Reinigung  
erfolgte an Kieselgel mit dem Laufmittelgemisch Ethylacetat/Cyclohexan im Ver-  
hältnis 6:1. Man erhält 1.34 g (70 % der Theorie) 2-{[3-(Formylamino)-2-  
hydroxybenzoyl]amino}-3-(4-hydroxyphenyl)propansäureethylester.

HPLC: logP = 1,83

20      Analog Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfin-  
dungsgemäßen Verfahren werden die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten  
Verbindungen der allgemeinen Formel (I-a) erhalten:



**Tabelle 1:**

Bsp.	R <sup>I1</sup>	R <sup>I3</sup>	R <sup>I2</sup>	logP
2	-H		-H	3,7
3	-H		-H	1,72
4	-H		-H	3,46
5	-CH <sub>3</sub>		-H	
6	-H		-H	2,21
7	-H		-H	1,73
8	-H		-H	2,26

**Tabelle 1:**

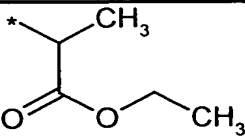
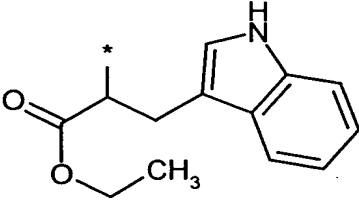
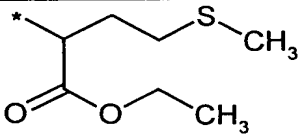
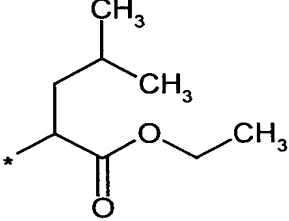
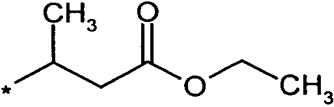
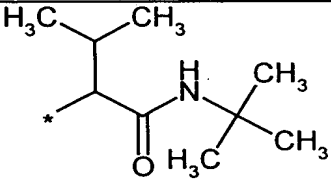
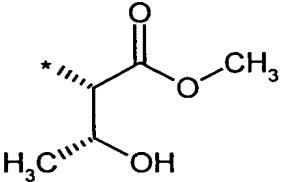
Bsp.	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>12</sup>	logP
9	-H		-H	1,64
10	-H		-H	2,41
11	-H		-H	2,13
12	-H		-H	2,61
13	-H		-H	1,73
14	-H		-H	2,17
15	-H		-H	



Tabelle 1:

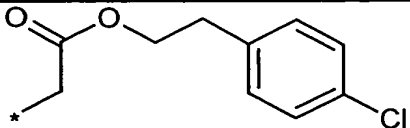
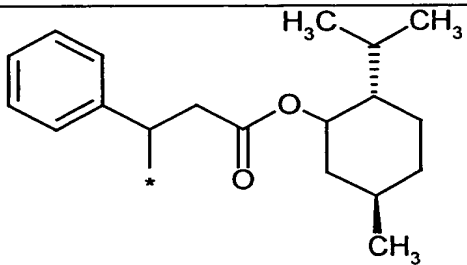
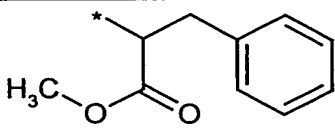
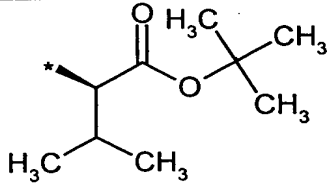
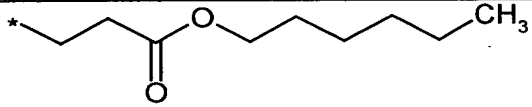
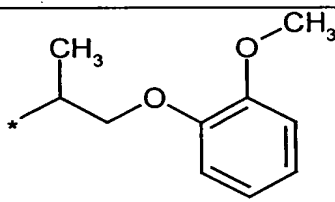
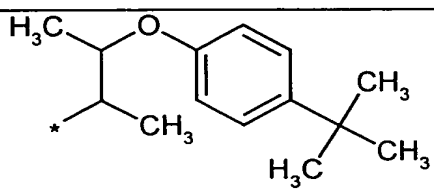
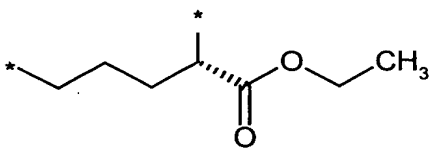
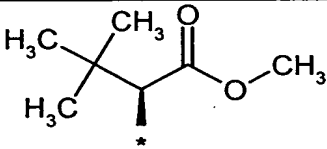
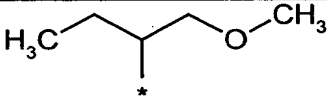
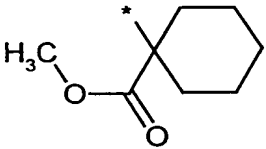
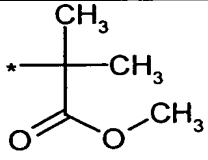
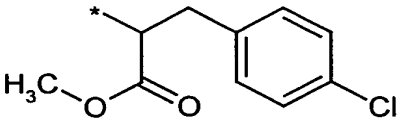
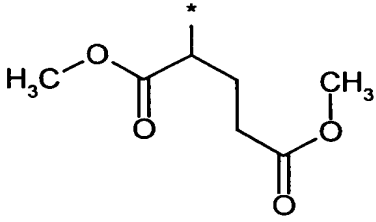
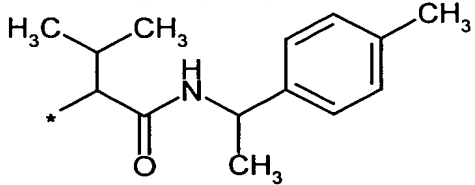
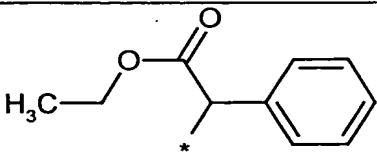
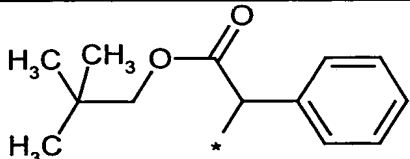
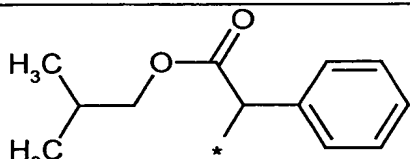
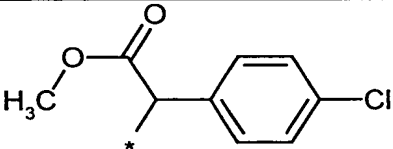
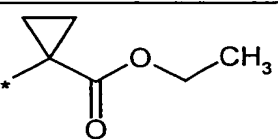
Bsp.	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>12</sup>	logP
16	-H		-H	2,56
17	-H		-H	4,71
18	-H		-H	2,27
19	-H		-H	1,52
20	-H		-H	2,93
21	-H		-H	2,36
22	-H		-H	4,03

Tabelle 1:

Bsp.	R <sup>I1</sup>	R <sup>I3</sup>	R <sup>I2</sup>	logP
23	-H			1,55
24	-H		-H	2,29
25	-H		-H	1,71
26	-H		-H	2,26
27	-H		-H	1,61
28	-H		-H	2,65
29	-H		-H	1,58

**Tabelle 1:**

Bsp.	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>12</sup>	logP
30	-H		-H	2,65
31	-H		-H	2,45
32	-H		-H	3,39
33	-H		-H	3,11
34	-H		-H	2,57
35	-H		-H	1,60

\* bezeichnet die Anknüpfungsstelle an das Stickstoffatom.

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

## Herstellung von Vorprodukten der Formel (IV)

### Beispiel (IV-1)

5      2-[(2-Hydroxy-3-nitrobenzoyl)amino]-3-(4-hydroxyphenyl)-propansäureethylester.

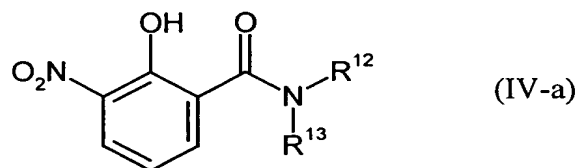
Verfahren d)

1.78 g (8.0 mmol) D,L-Tyrosinethylester Hydrochlorid werden in 20 mL Tetrahydrofuran gelöst und mit 1.1 mL (8 mmol) Triethylamin versetzt. Zu dem Reaktionsgemisch werden unter Rühren bei 0°C 1.61 g (8.0 mmol) 3-Nitrosalicylsäurechlorid, gelöst in 25 mL Tetrahydrofuran, zugetropft. Man läßt das Reaktionsgemisch innerhalb von 16 Stunden auf Raumtemperatur erwärmen. Das ausgefallene Triethylammoniumchlorid wird abfiltriert und die zurückbleibende Lösung am Rotationsverdampfer eingeengt. Der Rückstand wird in 200 mL Ethylacetat aufgenommen und mit 200 mL dest. Wasser extrahiert. Anschließend erfolgt die Trocknung der organischen Phase über Natriumsulfat. Das Lösungsmittel wurde am Rotationsverdampfer entfernt. Die Reinigung erfolgt an Kieselgel mit dem Laufmittelgemisch Ethylacetat/Cyclohexan im Verhältnis 10:1.

15      20      Man erhält 2.14 g (69 % der Theorie) 2-[(2-Hydroxy-3-nitrobenzoyl)amino]-3-(4-hydroxyphenyl)propansäureethylester.

HPLC: logP = 2,28

Analog Beispiel (IV-1) sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (IV) erhalten:

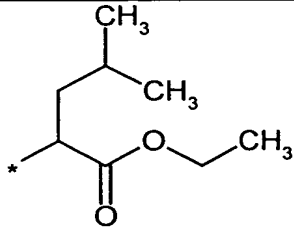
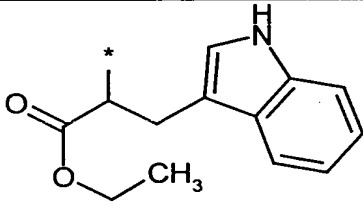
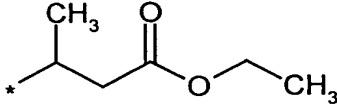
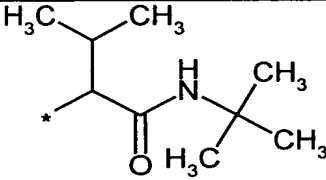
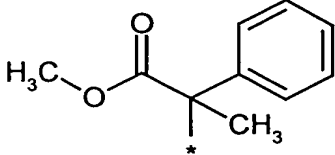
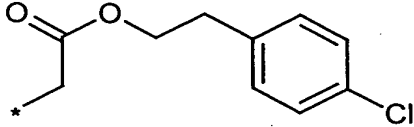


5

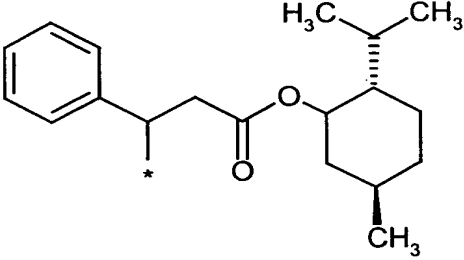
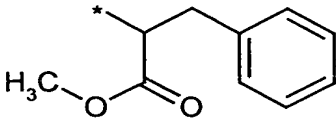
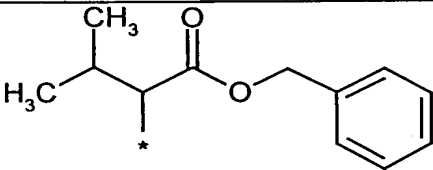
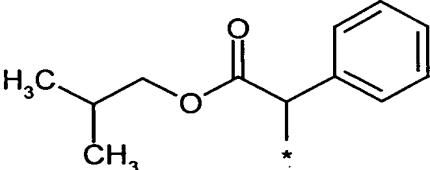
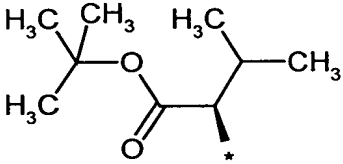
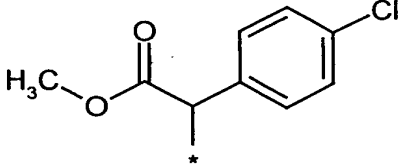
**Tabelle 2:**

Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-2	-H	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	1,47
IV-3	-H		2,79
IV-4	-H		2,16
IV-5	-H		2,82
IV-6	-H		2,68

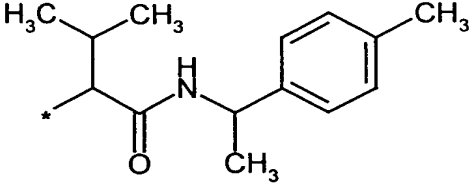
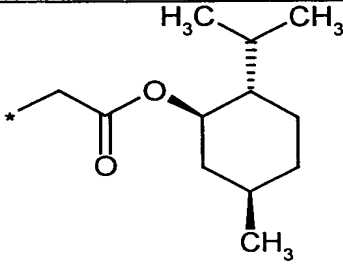
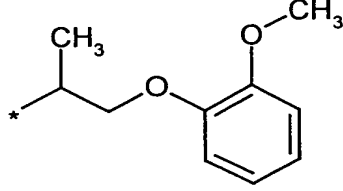
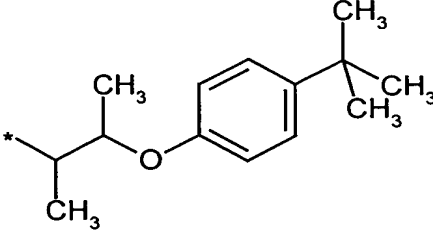
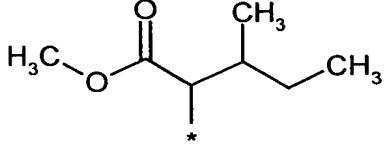
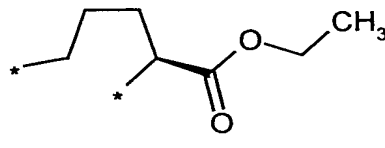
Tabelle 2:

Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-7	-H		3,23
IV-8	-H		2,93
IV-9	-H		2,25
IV-10	-H		2,65
IV-11	-H		2,85
IV-12	-H		3,1

**Tabelle 2:**

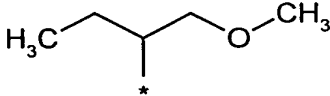
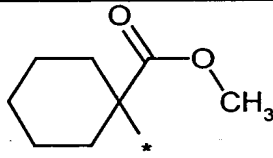
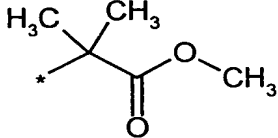
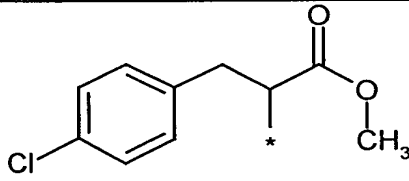
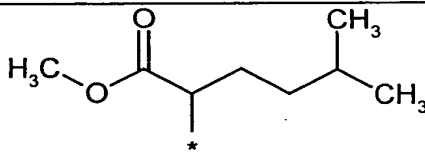
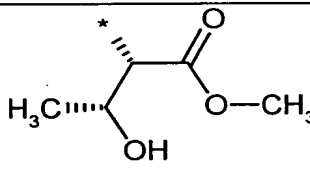
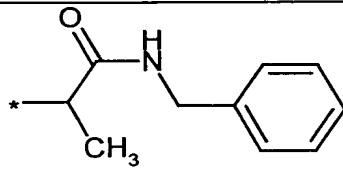
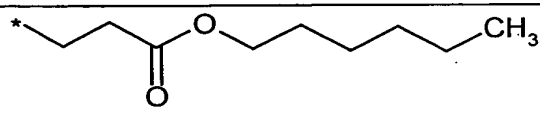
Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-13	-H		5,28
IV-14	-H		2,78
IV-15	-H		3,48
IV-16	-H		3,99
IV-17	-H		3,53
IV-18	-H		3,1

**Tabelle 2:**

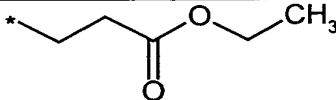
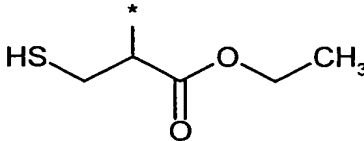
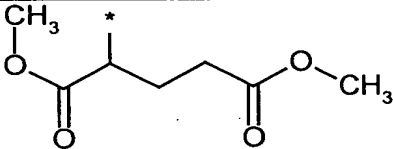
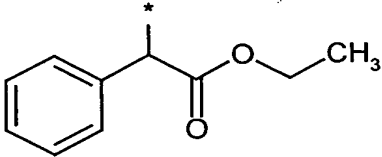
Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-19	-H		3,09
IV-20	-H		4,4
IV-21	-H		2,91
IV-22	-H		4,63
IV-23	-H		2,83
IV-24			1,86



**Tabelle 2:**

Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-25	-H		2,19
IV-26	-H		2,73
IV-27	-H		2,05
IV-28	-H		3,14
IV-29	-H		2,89
IV-30	-H		1,44
IV-31	-H		MPLC: m/e = 390,9
IV-32	-H		3,51

**Tabelle 2:**

Bsp.-Nr.	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>	logP
IV-33	-H		2,01
IV-34	-H		3,35
IV-35	-H		1,99
IV-36	-H		2,98

\* bezeichnet die Anknüpfungsstelle an das Stickstoffatom.

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wäßrige Phosphorsäure)

**Anwendungsbeispiele:****Beispiel A****5**      Phytophthora-Test (Tomate) / protektiv

Lösungsmittel:    24,5 Gewichtsteile Aceton

                         24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:        1,0 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

**15**      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Phytophthora infestans inokuliert. Die Pflanzen werden dann in einer Inkubationskabine bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

**20**      3 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

**25**      Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (2), (4), (8) und (12) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von 92 % oder mehr.

**Beispiel B**

Plasmopara-Test (Rebe) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:    24,5 Gewichtsteile Aceton  
                             24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator:            1,0 Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Plasmopara viticola* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Inkubationskabine bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 5 Tage im Gewächshaus bei ca. 21°C und ca. 90 % Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Inkubationskabine gestellt.

20      6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

- 25      Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (2), (4), (6), (8) und (12) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von 97 % oder mehr.

**Beispiel C**

Botrytis-Test (Bohne) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:    24,5 Gewichtsteile Aceton  
                             24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator:            1,0 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

- 20      2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

- 25      Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (2), (4), (6), (8) und (12) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha einen Wirkungsgrad von 90 % oder mehr.

**Beispiel D**

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

- 5      Lösungsmittel: 48,8 Gewichtsteile    Aceton  
Emulgator:      1,2    Gewichtsteile    Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

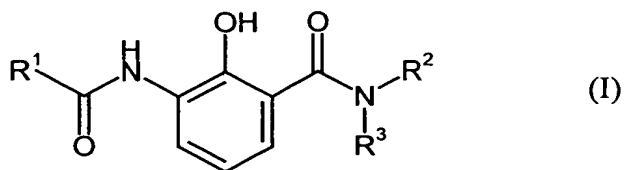
- 15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert und verbleiben dann 24h bei 100% rel. Luftfeuchte und 26°C. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 80 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 26°C aufgestellt.

- 20      7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

- 25      Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (1), (8), (9), (10) und (12) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 750 g/ha einen Wirkungsgrad von 89 % oder mehr.

Patentansprüche

1. Verwendung von Verbindungen der Formel (I),

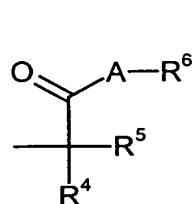


in welcher

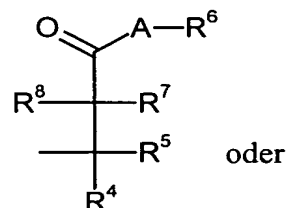
$R^1$  für Wasserstoff oder Alkyl steht,

$R^2$  für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder

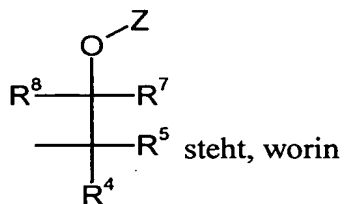
$R^3$  für eine Gruppierung



oder



oder



A für Sauerstoff, Schwefel oder  $-(N-R^9)-$  steht, worin

$R^9$  für Wasserstoff oder Alkyl steht oder gemeinsam mit  $R^6$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bildet,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl steht oder

R<sup>2</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden,

R<sup>6</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

R<sup>7</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

R<sup>8</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht und

Z für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Aryl, Arylcarbonyl, Heterocyclyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,

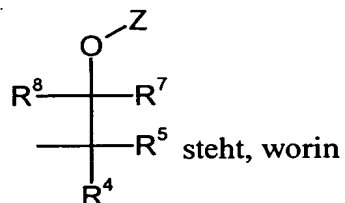
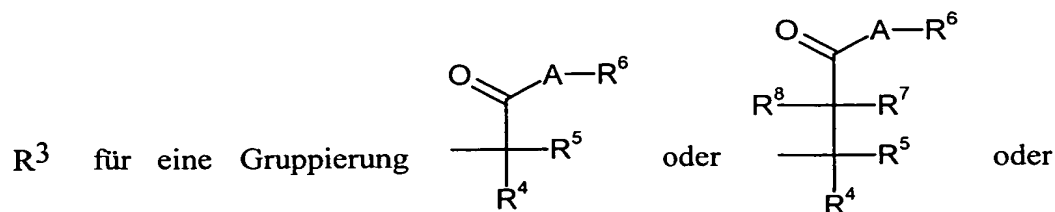
zur Bekämpfung von Organismen, die Pflanzenschäden und Schäden an technischen Materialien verursachen.

2. Verwendung von Verbindungen der Formel (I), gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und





A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N} \text{---} \text{R}^9)\text{---}$  steht, worin

$R^9$  für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht oder gemeinsam mit  $R^6$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls durch  $\text{C}_1\text{--C}_4$ -Alkyl substituierten heterocyclischen Ring mit 3 bis 7 Ringgliedern bildet,

$R^4$  für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht oder

$R^2$  und  $R^4$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

5

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

10

R<sup>6</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

15

R<sup>7</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

R<sup>8</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und

20

Z für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl oder Alkylcarbonyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Cycloalkylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylcarbonyl, Arylalkyl, Arylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylalkyl oder Heterocyclylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

25

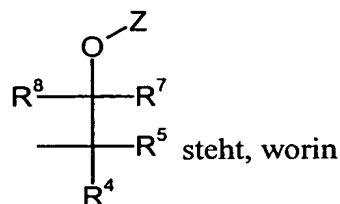
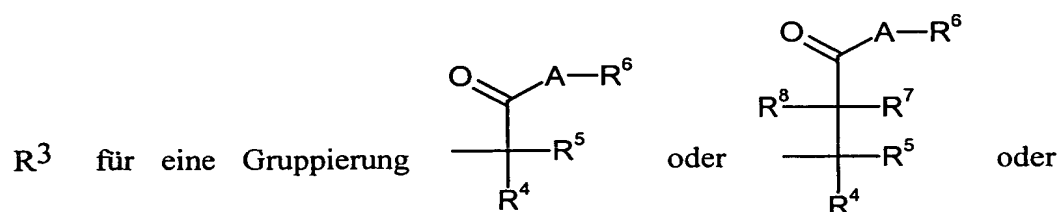
zur Bekämpfung von Organismen, die Pflanzenschäden und Schäden an technischen Materialien verursachen.

30

3. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^1$  für Wasserstoff oder Methyl steht,

$R^2$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und



A für Sauerstoff, Schwefel oder  $-(\text{N}-\text{R}^9)-$  steht, worin

$R^9$  für Wasserstoff oder Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder gemeinsam mit  $R^6$  und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituiertes Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Piperidinyl, Piperazinyl oder Hexahydroazepinyl steht,

$R^4$  für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propyl-

carbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl steht oder

5

R<sup>2</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

10

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropanring, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen,

15

R<sup>6</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl oder Cyclohexyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyll, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl oder Morpholinylbutyl, durch Pyrrolidonyl substituiertes Methyl, Ethyl oder Propyl steht,

20

25

R<sup>7</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

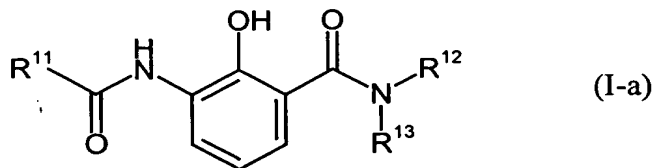
30

R<sup>8</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

Z für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n- oder i-Propylcarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylcarbonyl, Pentylcarbonyl, Hexylcarbonyl, Heptylcarbonyl, Octylcarbonyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentylcarbonyl oder Cyclohexylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyl, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl, Phenylcarbonyl, Benzylcarbonyl, 1-Phenethylcarbonyl, 2-Phenethylcarbonyl, Phenylcarbonylpropylcarbonyl, Phenylcarbonylbutylcarbonyl, Phenylcarbonylpentylcarbonyl oder Phenylcarbonylhexylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonyl, Morpholinylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonylbutylcarbonyl oder Morpholinylcarbonylbutylcarbonyl steht,

zur Bekämpfung von Organismen, die Pflanzenschäden und Schäden an technischen Materialien verursachen.

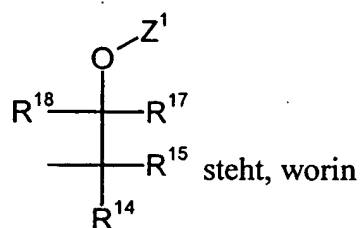
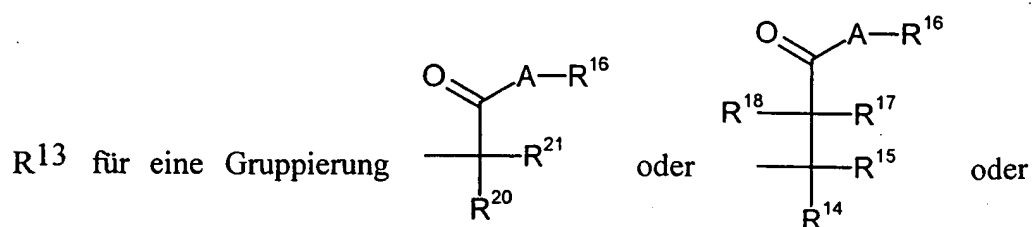
4. Verbindungen der Formel (I-a),



in welcher

R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

R<sup>12</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht, oder



A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N-R}^{19})\text{---}$  steht, worin

R<sup>19</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder gemeinsam mit R<sup>16</sup> und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bildet,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

R<sup>15</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht und

R<sup>18</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

5 Z<sup>1</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Aryl, Arylcarbonyl, Heterocyclyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,

R<sup>20</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Hetaryl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

15 R<sup>21</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht oder

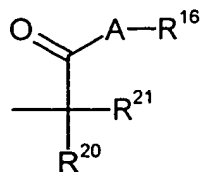
R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden.

20 5. Verbindungen der Formel (I-a), gemäß Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß

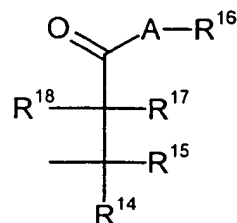
R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

25 R<sup>12</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und

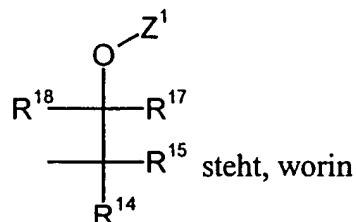
R<sup>13</sup> für eine Gruppierung



oder



oder



steht, worin

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N-R}^{19})\text{---}$  steht, worin

R<sup>19</sup> für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht oder gemeinsam mit R<sup>16</sup> und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten heterocyclischen Ring mit 3 bis 7 Ringgliedern bildet,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

BEST AVAILABLE COPY



R<sup>15</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder durch Pyrrolidonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und

R<sup>18</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

Z<sup>1</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl oder Alkylcarbonyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl oder Cycloalkylcarbonyl, jeweils gegebenenfalls im Aryl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Arylcarbonyl, Arylalkyl, Arylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Heterocyclyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylalkyl oder Heterocyclylalkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

R<sup>20</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Hetero-

cyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

5

R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden,

R<sup>21</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht oder

R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring mit 3 bis 6 Ringgliedern bilden.

15

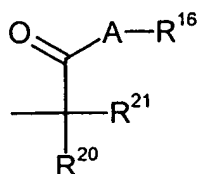
6. Verbindungen der Formel (I-a), gemäß Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß

R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

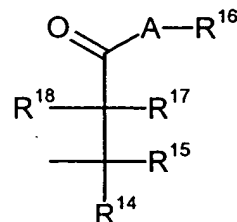
20

R<sup>12</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

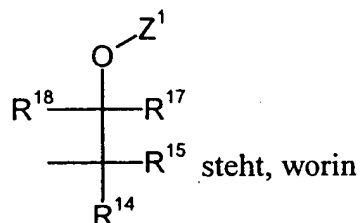
R<sup>13</sup> für eine Gruppierung



oder



oder



steht, worin

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{---}(\text{N-R}^{19})\text{---}$  steht, worin

R<sup>19</sup> für Wasserstoff oder Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder gemeinsam mit R<sup>16</sup> und dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls durch Methyl oder Ethyl substituiertes Pyrrolidiny, Morpholiny, Piperidiny, Piperaziny oder Hexahydroazepiny steht,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Hydroxy, Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>14</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

R<sup>15</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

5

R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropan-, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen,

R<sup>16</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl oder Cyclohexyl, jeweils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyll, Morpholinyl, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinylbutyl oder durch Pyrrolidonyl substituiertes Methyl, Ethyl oder Propyl steht,

15

R<sup>17</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht und

20

R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

25

Z<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n- oder i-Propylcarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylcarbonyl, Pentylcarbonyl, Hexylcarbonyl, Heptylcarbonyl, Octylcarbonyl, gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl substituiertes Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentylcarbonyl oder Cyclohexylcarbonyl, je-

30

weils gegebenenfalls im Phenyl- bzw. Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, Benzyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl, Phenylpropyl, Phenylbutyl, Phenylpentyl oder Phenylhexyl, Pyrrolidinyll, Morpholinyll, Pyrrolidinylbutyl, Morpholinyllbutyl, Phenylcarbonyl, Benzylcarbonyl, 1-Phenethylcarbonyl, 2-Phenethylcarbonyl, Phenylcarbonylpropylcarbonyl, Phenylcarbonylbutylcarbonyl, Phenylcarbonylpentylcarbonyl oder Phenylcarbonylhexylcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonyl, Morpholinyllcarbonyl, Pyrrolidinylcarbonylbutylcarbonyl oder Morpholinyllcarbonylbutylcarbonyl steht,

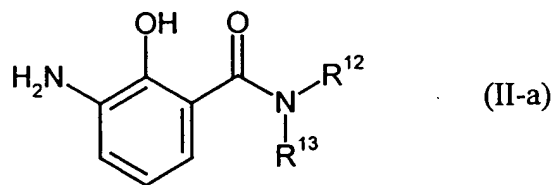
R<sup>20</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl oder substituiertes Benzyl steht oder

R<sup>12</sup> und R<sup>20</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen,

R<sup>21</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht oder

R<sup>20</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopropanring, Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

7. Verbindungen der Formel (II-a),

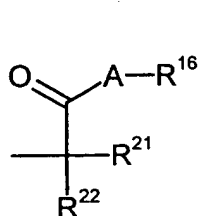


in welcher

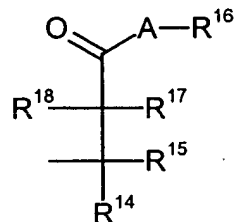
5

R<sup>12</sup> die oben angegebene Bedeutung hat, und

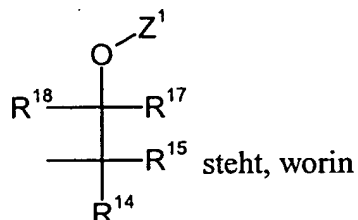
R<sup>13</sup> für eine Gruppierung



oder



oder



steht, worin

10

A, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, Z<sup>1</sup> und R<sup>21</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

R<sup>22</sup> für durch Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder unsubstituiertes C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder Heterocyclylalkyl mit 1

15

20

bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

5

$R^{22}$  und  $R^{12}$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden,

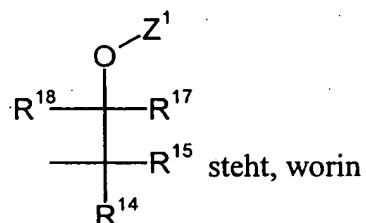
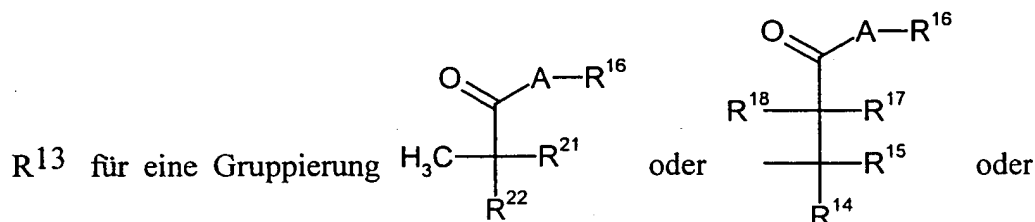
$R^{22}$  und  $R^{21}$  gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen carbocyclischen Ring bilden.

10

8. Verbindungen der Formel (II-a), gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß

$R^{12}$  die oben angegebene Bedeutung hat, und

15



A,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $Z^1$  und  $R^{21}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

$R^{22}$  für durch Formyloxy, gegebenenfalls im Arylteil substituiertes Arylcarbonyloxy oder Alkoxy, Alkylthio, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil substituiertes  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder unsubstituiertes  $C_2$ -

C<sub>4</sub>-Alkyl, jeweils gegebenenfalls im Arylteil, bzw. Heterocyclylteil substituiertes Aryl, Heterocyclyl, Arylalkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder substituiertes Benzyl steht oder

5

R<sup>22</sup> und R<sup>12</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen oder

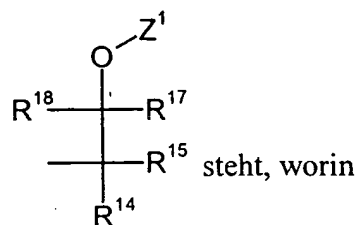
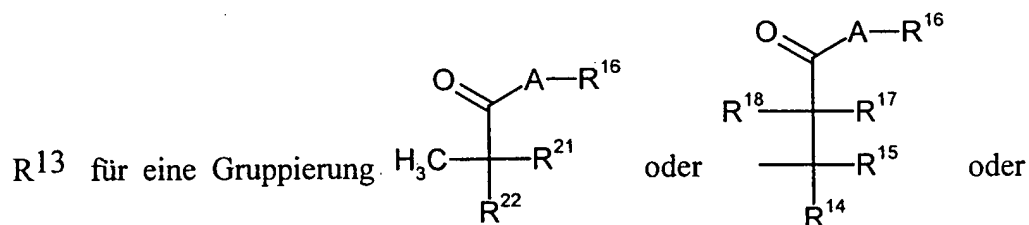
R<sup>22</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

10

9. Verbindungen der Formel (II-a), gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß

15

R<sup>12</sup> die oben angegebene Bedeutung hat, und



20

A, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>, Z<sup>1</sup> und R<sup>21</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

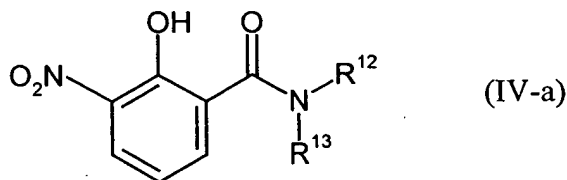


5 R<sup>22</sup> für jeweils durch Formyloxy, gegebenenfalls im Phenylteil substituiertes Phenylcarbonyloxy, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, Propylcarbonyloxy, Pentylcarbonyloxy oder Hexylcarbonyloxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder unsubstituiertes Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, jeweils gegebenenfalls im Phenylteil oder Heterocyclylteil substituiertes Phenyl, 1-Phenethyl, 2-Phenethyl oder Indolylmethyl oder substituiertes Benzyl steht oder

10 R<sup>22</sup> und R<sup>12</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Pyrrolidin- oder Piperidinring stehen oder

15 R<sup>22</sup> und R<sup>21</sup> gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Cyclopentan- oder Cyclohexanring stehen.

10. Verbindungen der Formel (IVa),



in welcher

R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> die in Anspruch 4 angegebene Bedeutung haben.

25 11. Mittel enthaltend Streckmittel und/oder Trägerstoffe sowie gegebenenfalls oberflächenaktive Stoffe, gekennzeichnet durch einen Gehalt von mindestens einer Verbindung wie in den Ansprüchen 4 bis 6 definiert.

BEST AVAILABLE COPY

12. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen wie in den Ansprüchen 4 bis 6 bzw. Mittel wie in Anspruch 11 definiert auf Schädlinge und/oder dessen Lebensraum einwirken läßt.

5

13. Verwendung von Verbindungen wie in den Ansprüchen 4 bis 6 bzw. Mittel wie in Anspruch 11 definiert zur Bekämpfung von Schädlingen.

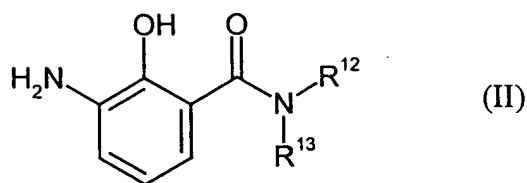
14. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen wie in den Ansprüchen 4 bis 6 definiert mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

10

15. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I-a) wie in Anspruch 4 definiert, dadurch gekennzeichnet, daß man

15

a) Aminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (II),



in welcher

R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einem Acylierungsmittel der allgemeinen Formel (III),

25



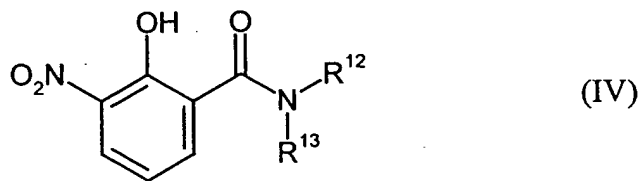
in welcher

$R^{11}$  die oben angegebene Bedeutung hat und

5  $X^1$  für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt, oder wenn man

10 b) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

15

$R^{12}$  und  $R^{13}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt.

20

Aminosalicylsäureamide

Z u s a m m e n f a s s u n g

Die Erfindung betrifft bekannte und neue Acylaminosalicylsäureamide, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzen-schädigenden Organismen, sowie neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren Herstellung.